

Application no/date: 1979- 48271[1979/ 4/18]
 Date of request for examination: [1981/ 6/17]
 Accelerated examination ()
 Public disclosure no/date: 1980-138457 ~~Translate~~ [1980/10/29]
 Examined publication no/date (old law): 1982- 4267 ~~Translate~~ [1982/ 1/25]
 Registration no/date: 1118561[1982/10/28]
 Examined publication date (present law): []
 PCT application no:
 PCT publication no/date: []
 Applicant: TOKAI CAPSULE KK
 Inventor: YAMADA TATSU
 IPC: A61J 3/07 =A61K 9/48
 FI: A61J 3/07 D A61K 9/48 E
 F-Term: 4C076AA56,AA58,BB01,CC11,DD01,DD38H,EE23A,EE42H,EE42A,EE42B,EE42Q,FF06
 ,FF23,FF33,FF36,FF57,FF70
 Expanded classification: 144,282

Fixed keyword:

Citation: [, , ,] (, ,)

Title of invention: FUSIBLE SOFT CAPSULE

Abstract: Fortunetelling compatibilization can place soft capsule by using *modefuaidozerachi* which blockaded amino group in gelatine molecular with organic acid.
 The thing which did blending ratio of coal of *modefuaidozerachin* than 30% in blending gelatine with *modefuaidozerachin* and the gelatine which blockaded amino group in gelatine molecular with organic acid is done with backing material, the glycerin which gives this flexibility and water retention is added, and capsule is formed.

⑩ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55-138457

⑬ Int. Cl.³

A 61 J 3/07

A 61 K 9/48

識別記号

庁内整理番号

6670-4C

7057-4C

⑭ 公開 昭和55年(1980)10月29日

発明の数 1

審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑮ 易溶性軟カプセル

⑯ 特 願 昭54-48271

⑰ 出 願 昭54(1979)4月18日

⑱ 特 願 昭49-13055の追加

⑲ 発 明 者 山田達

富士市今泉3-1-33

⑳ 出 願 人 東海カプセル株式会社

富士市久沢168番地

㉑ 代 理 人 弁理士 橋山御一

明 細 書

1. 発明の名称 易溶性軟カプセル

2. 特許請求の範囲

ゼラチン分子中のアミノ基も有機酸で封鎖したモダファイドゼラチンと、ゼラチンとの混合ゼラチンで、上記モダファイドゼラチンの配合割合を30%以上としたものを基剤とし、之に柔軟性と保水性とを与えるグリセリン等を加えてカプセルを形成し、軟カプセルの急速な溶解を可能としたことを特徴とする易溶性軟カプセル。

3. 発明の詳細な説明

本発明は、昭和49年特許願第13055号に係る易溶性軟カプセルの改良に係るものである。

従来から経口投与薬品の崩壊時間は、通常日

本要局方一般試験法の崩壊試験法により、第一液を用いて試験するとき、20分以内に崩壊しなければならないと規格が定められており、又、最近のレクタルカプセルと云う易溶軟カプセルの崩壊時間は、試験液に水を用いて試験するとき、20分以内に崩壊しなければならないと規格が定められた。

この場合、薬剤の崩壊は、軟カプセル壁の一部又は全部が溶解した後にはじまるから、より崩壊性を良好にしようとする場合、当然カプセル壁が易溶性であることが必要となる。

一般的に軟カプセル薬剤を加温放置して、経時的にその崩壊試験を行うと、崩壊時間は次第に延ばす。内溶液にポリエチレングリコール等を用いた場合、この現象は更に顕著となる。

前述の通り、薬剤の崩壊に要する時間は20

分以内でないと、日本薬局方の一般試験法崩壊試験法に不適合となり、その薬剤は医薬品としての価値を失う。

そこで原発明においては、ゼラチン分子中のアミノ基を有機酸で封鎖したモダフアイドゼラチンの易溶性に留意し、これを用いて軟カプセルを製造し、崩壊時間が数分以内と云う軟カプセルの易溶化に成功した。しかし、上記モダフアイドゼラチンは、ゼラチンに比較して高価であるため、コストに関係なく易溶性のみが要求される薬剤等には利用出来るが、崩壊時間が規格の20分以内であれば、なるべく低コストであることが要求される薬剤等の軟カプセルには向かないから、本発明者は、上記モダフアイドゼラチンにゼラチンを混合してもその混合比を適当に選定すれば、規格の20分以内に崩壊す

131

れている。

混合比	経 時	開始時	1ヶ月
コハク化ゼラチン	0:100	6~7分	13~17分
"	10:90	6~7分	10~12分
"	20:80	6~8分	6~8分
"	30:70	4~6分	3~4分
"	40:60	4~6分	4~5分
"	50:50	3~5分	3~6分
"	80:20	3~4分	3~5分
"	100:0	3~4分	4~5分

2ヶ月	3ヶ月	4ヶ月	6ヶ月
19~20分	20分以上	20分以上	20分以上
16~19分	20分以上	20分以上	20分以上
12~16分	13~16分	18~20分	20分以上
7~8分	7~9分	8~10分	12~13分
5~8分	5~9分	7~10分	9~13分
4~5分	5~9分	6~9分	5~10分
4~5分	5~6分	4~5分	5~6分
3~5分	4~6分	3~4分	4~5分

151

る易溶性軟カプセルが製造可能であると考え、種々の混合割合のゼラチン混合物を用いてポリエチレングリコール0.4gを内容物とした軟カプセルを形成し、この軟カプセルを40℃に6ヶ月間放置しても、20分以内の適切な崩壊時間が得られるモダフアイドゼラチンとゼラチンとの混合割合を検討した。(40℃に6ヶ月間放置は、通常の室温において4~5年間の保存に相当すると考えられ、医薬品の場合この程度の期間経過的に安定であれば、市場での存在期間から考えて充分であると考えられる。)

その結果は下表の通りで、モダフアイドゼラチンとゼラチンとの混合物を用いた軟カプセルでも、モダフアイドゼラチンの配合割合を30%以上とすれば、規格に適合する崩壊時間が得られることが判明し、本発明の有効性が証明さ

141

次に本発明に係る易溶性軟カプセルの製造方法の一実施例を示せば下記の通りである。

実施例1

コハク化ゼラチン40部、ゼラチン60部、グリセリン20部、ソルビトール20部の軟カプセル製造成分を電りとり、之に約50%の水溶液となる様に蒸留製水を加えた後、70~80℃にて撹拌溶解し、真空ポンプを用いて脱泡し、コハク化ゼラチンと他の処方剤との混合物のゾル溶液を得た。

次にこのゾル溶液を公知のスプレッダーボックス(薄層クロマトグラフのアプリケーターと同じ原理)にて一定の厚さに調整し、冷乾燥風を吹き付けながらゲル化させ、均一な厚さの薄板とした。

その次にゲル化した薄板二枚を左右対称の回

161

転する筒型の間に挟み、カプセル壁を造りながらポンプによりポリエチレングリコールを主剤とし、之にニフエジン、界面活性剤とを加えた混合溶液の、4gをカプセル壁中に加圧充填すると同時に、筒型の回転によりカプセル壁を圧着閉塞して軟カプセルとし、之を温風により乾燥すると、上記混合溶液を内容物とする内容量の4gの軟カプセルが製造された。

実施例2

コハク化ゼラチン30部、ゼラチン70部、グリセリン20部、白糖15部を軟カプセル壁構成成分とし、植物油を基剤とし、アミノピリン、界面活性剤、硬化油を内溶液として実施例1と同様の方法でカプセルを製造した。この場合は上記混合溶液を内容物とする内容量の4gの軟カプセルが得られた。

(7)

4 追加の関係

本発明は、昭和49年特許願第13055号に係る易溶性軟カプセルの追加発明に係るもので、ゼラチン分子中のアミノ基を有機酸で封鎖したモデフアイドゼラチンを基剤とし、之に柔軟性と保水性とを与えるグリセリンを加えてカプセルを形成し、該カプセルの急速な溶解を可能とした点において原発明の権利を使用し、モデフアイドゼラチンのみの基剤を、モデフアイドゼラチンの配合割合を30%以上としたゼラチンとの混合体とすることにより、高価なモデフアイドゼラチンの使用量を減らし、易溶性軟カプセルのコストダウンを図った点において原発明の効果を助長したものである。

特許出願代理人 橋 山

印



(8)

Best Available Copy